

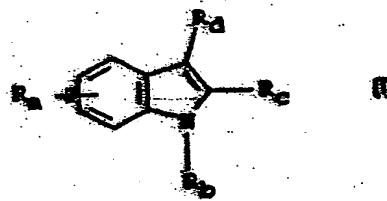


(51) Internationale Patentklassifikation ⁶ : C07D 209/12, A61K 31/40, C07D 401/12, 413/12, 403/12, 405/12, 417/12, 209/42, 209/08		A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 99/28297
			(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 10. Juni 1999 (10.06.99)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP98/07661	(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BE, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KE, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
(22) Internationales Anmeldedatum: 27. November 1998 (27.11.98)	
(30) Prioritätsdaten: 197 53 522.4 3. Dezember 1997 (03.12.97) DE	
(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten außer US): BOEHRINGER INGELHEIM PHARMA KG [DE/DE]; Binger Straße 173, D-53216 Ingelheim (DE).	
(72) Erfinder, und	
(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): HECKEL, Armin [DE/DE]; Geschwister-Scholl-Straße 71, D-88400 Biberach (DE); WALTER, Rainer [DE/DE]; Probststraße 3, D-88400 Biberach (DE); SOYKA, Rainer [DE/DE]; Geschwister-Scholl-Straße 43, D-88400 Biberach (DE); STASSEN, Jean-Marie [BE/DE]; Berggasseweg 11, D-88447 Warthausen (DE); WEINMANN, Wolfgang [DE/DE]; Kirschenweg 27, D-88400 Biberach (DE); BINDER, Klaus [DE/DE]; Biebricher Allee 13, D-65167 Wiesbaden (DE).	
(74) Anwalt: LAUDEN, Dieter, Boehringer Ingelheim GmbH, Patentabteilung, D-53216 Ingelheim/Rhein (DE).	

(54) Titel: SUBSTITUTED INDOLES, HAVING A THROMBIN INHIBITING EFFECT

(54) Bezeichnung: SUBSTITUIERTE INDOLE MIT THROMBIN-HEMMENDER WIRKUNG



(55) Abstract

The invention relates to novel substituted indoles of general formula (I) in which R₁ to R₄ are defined as in claim 1. The invention, stereoisomers, mixtures and salts of R₁ to R₄ have valuable properties. The compounds of general formula (I) in which R₁ or R₂ contains a cyanophenyl group form valuable intermediate products in order to produce the remaining compounds of general formula (I), and the compounds of general formula (I) in which R₃ or R₄ contain a R₁NH-C(=NH)-phenyl group in addition to the tautomers and stereoisomers thereof have valuable pharmacological properties, especially a thrombin inhibiting effect which extends the thrombin time and a fibrinogen receptor antagonistic effect.

(57) Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft neue substituierte Indole der allgemeinen Formel (I), in der R₁ bis R₄ wie im Anspruch 1 definiert sind, deren Tautomere, deren Stereoisomere, deren Gemische und deren Salze, welche wertvolle Eigenschaften aufweisen. So stellen die Verbindungen der obigen allgemeinen Formel (I), in denen R₁ oder R₂ eine Cyanophenylgruppe enthalten, stellten wertvolle Zwischenprodukte zur Herstellung der übrigen Verbindungen der allgemeinen Formel (I) dar, und die Verbindungen der obigen allgemeinen Formel (I), in denen R₃ oder R₄ eine R₁NH-C(=NH)-phenylgruppe enthalten, sowie deren Tautomere und deren Stereoisomere weisen wertvolle pharmakologische Eigenschaften auf, insbesondere eine antitrombotische Wirkung, eine die Thrombinzeit verlängernde Wirkung und eine Fibrinogenrezeptorantagonistische Wirkung.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäß dem PCT veröffentlichen.

AL	Albania	ES	Spanien	LS	Lettland	SI	Slowenien
AM	Armenia	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Geben	LV	Lettland	SZ	Sveitsland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TC	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tschadischen
BE	Belgien	GN	Geben	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Tschadischen Tschad
BP	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mal	TT	Tschad und Tchad
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BJ	Benin	ID	Irland	MR	Marokko	UG	Uganda
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	UZ	Uzbekistan
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	VN	Vietnam
CZ	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	YU	Jugoslawien
CG	Kongo	KZ	Kenia	NO	Norwegen	ZW	Zimbabwe
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NL	Norwegen		
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CJ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Eesti						